

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 8 月 18 日 (18.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/075414 A1

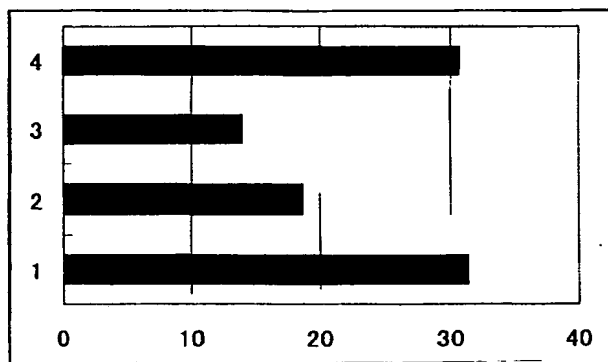
- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 279/14, A61K  
31/198, 45/00, A61P 19/02, 29/00, 43/00
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2005/001574
- (22) 国際出願日: 2005 年 2 月 3 日 (03.02.2005)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願2004-028467 2004 年 2 月 4 日 (04.02.2004) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 公立大学法人横浜市立大学 (YOKOHAMA CITY UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒2360027 神奈川県横浜市金沢区瀬戸 2 2 番 2 号 Kanagawa (JP).

- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 佐藤 衛 (SATO, Mamoru) [JP/JP]; 〒2380111 神奈川県三浦市初声町下宮田 8 2 1 メイプル一番館 2 0 2 Kanagawa (JP). 清水 敏之 (SHIMIZU, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒2360017 神奈川県横浜市金沢区西柴 2-3 1 A-2 0 3 Kanagawa (JP). 橋本 博 (HASHIMOTO, Hiroshi) [JP/JP]; 〒2300062 神奈川県横浜市鶴見区豊岡町 3 8-2 6 コーポシルビア 5 2 0 8 号 Kanagawa (JP). 山田 道之 (YAMADA, Michiyuki) [JP/JP]; 〒2360045 神奈川県横浜市金沢区釜利谷南 1-3 E-4 1 6 Kanagawa (JP). 日高雄二 (HIDAKA, Yuji) [JP/JP]; 〒5670023 大阪府茨木市西河原 2 丁目 2 1 番 3 9 号 ヴィラソレイユ 3 0 5 Osaka (JP).

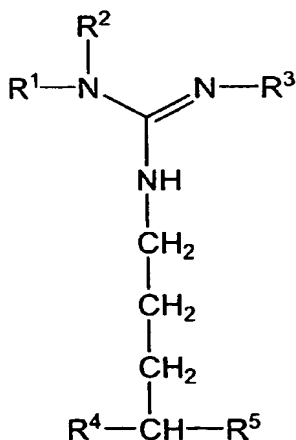
[続葉有]

(54) Title: PEPTIDYL ARGININE DEIMINASE TYPE IV INHIBITOR

(54) 発明の名称: ペプチジルアルギニンデイミナーゼ 4 阻害剤



(57) Abstract: A compound represented by the following general formula (I) or a salt thereof. [Chemical formula 1] (I) (In the formula, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, and R<sup>3</sup> each independently represents hydrogen or C<sub>1-3</sub> alkyl, provided that at least one of R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, and R<sup>3</sup> is not hydrogen; R<sup>4</sup> represents substituted amino; and R<sup>5</sup> represents optionally substituted carboxy.) Also provided is a peptidyl arginine deiminase type IV inhibitor. With this inhibitor, diseases in which a peptidyl arginine deiminase participates (e.g., articular rheumatism and multiple sclerosis) can be prevented and/or treated.



(I)

[続葉有]



(74) 代理人: 間山 世津子, 外(MAYAMA, Setsuko et al.);  
〒2210835 神奈川県横浜市神奈川区鶴屋町3丁目  
30番の1 農機会展館4階 Kanagawa (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,

SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

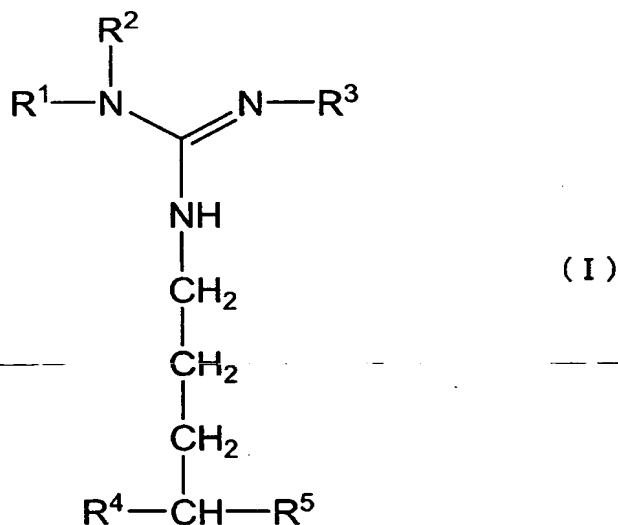
- 国際調査報告書
- 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。
- 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部分、請求に基づき国際事務局から入手可能

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

【解決手段】 下記の一般式(I)で表される化合物またはその塩。

【化1】



(式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ および $\text{R}^3$ は、それぞれ独立に、水素原子または炭素数1-3のアルキル基であるが、ただし、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ および $\text{R}^3$ のうちの少なくとも1つは水素原子ではなく、 $\text{R}^4$ は置換基を有するアミノ基であり、 $\text{R}^5$ は置換基を有してもよいカルボキシル基である)

また、ペプチジルアルギニンデイミナーゼ4阻害剤も提供される。この阻害剤を利用することにより、ペプチジルアルギニンデイミナーゼが関与する疾患(例えば、関節リウマチ、多発性硬化症など)を予防および／または治療することができる。